

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年4月28日 (28.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/037760 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 47/565, 69/84, C07D 307/32, A61K 47/10, 31/341, 31/11, 31/12, 31/235, A61P 33/02[JP/JP]; 〒1070061 東京都港区北青山1-5-12  
Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/015390

(74) 代理人: 杉本 一夫, 外(SHAMOTO, Ichio et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町二丁目2番1号 新大手町ビル206区 ユアサハラ法律特許事務所 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2004年10月18日 (18.10.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
PCT/JP03/13310  
2003年10月17日 (17.10.2003) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): アリジエン株式会社 (ARIGEN, INC.) [JP/JP]; 〒1070061 東京都港区北青山1丁目5番12号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および  
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 斎本 博之 (SAIMOTO, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒6800945 鳥取県鳥取市湖山町南五丁目626 Tottori (JP). 重政 好弘 (SHIGEMASA, Yoshihiro) [JP/JP]; 〒6890202 鳥取県鳥取市美萩野一丁目48 Tottori (JP). 北潔 (KITA, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒1130033 東京都文京区本郷7-3-1 Tokyo (JP). 蔡 義貞 (YABU, Yoshisada) [JP/JP]; 〒4670001 愛知県名古屋市瑞穂区瑞穂町宇川澄 Aichi (JP). 細川 知良 (HOSOKAWA, Tomoyoshi) [JP/JP]; 〒1070061 東京都港区北青山1-5-12 Tokyo (JP). 山本 雅一 (YAMAMOTO, Masaichi)

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

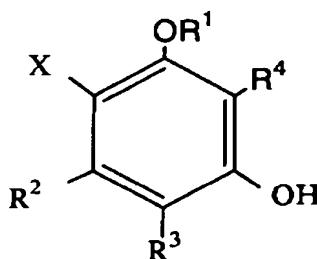
(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL PHENOL DERIVATIVES AND ANTITRYPANOSOMA PREVENTIVE/THERAPEUTIC AGENT CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: 新規フェノール誘導体およびそれらを有効成分とする抗トリパノソーマ予防・治療剤



(57) Abstract: Compounds represented by the formula (I): [Chemical formula 1] (I) (wherein, for example, X represents hydrogen or halogeno; R<sup>1</sup> represents hydrogen; R<sup>2</sup> represents hydrogen or C<sub>1-4</sub> alkyl; R<sup>3</sup> represents -CHO or -COOH; and R<sup>4</sup> represents -CH=CH-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CH<sub>3</sub> (wherein p is an integer of 1 to 12), -CH(OH)-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-CH<sub>3</sub> (wherein q is an integer of 1 to 13), -CH(OH)-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CH=C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH=CH-CH(CH<sub>3</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, or -(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>-CH<sub>3</sub>), optical isomers of these, and pharmaceutically acceptable salts of these. These compounds have antitrypanosoma activity and are hence useful as a drug for the prevention of or treatments for diseases caused by trypanosome.

WO 2005/037760 A1

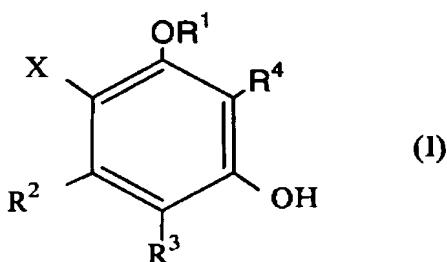
(続葉有)



(57) 要約:

式(I)

【化1】



(式中、例えば、

Xは水素原子またはハロゲン原子を表し、

R¹は、水素原子を表し、

R²は、水素原子または炭素数1-4のアルキル基を表し、

R³は-CHOまたは-COOHを表し、および、

R⁴は、-CH=CH-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-CH<sub>3</sub> (式中、pは1-12の整数を表す)、または-CH(OH)-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-CH<sub>3</sub> (式中、qは1-13の整数を表す)、-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CH=C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH=CH-CH(CH<sub>3</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>8</sub>-CH<sub>3</sub>を表す)

で示される化合物、それらの光学異性体、およびそれらの医薬上許容される塩。これらの化合物は、抗トリパノソーマ活性を有するので、トリパノソーマによって惹起される疾患を予防または治療する薬剤として有用である。